

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
11. August 2005 (11.08.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/073213 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 317/44,
491/08, 209/52

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2005/000643

(22) Internationales Anmeldedatum:
24. Januar 2005 (24.01.2005)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
04002055.4 30. Januar 2004 (30.01.2004) EP

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): LONZA AG (CH/CH); Münchensteinerstrasse 38,
CH-4052 Basel (CH).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): GRIFFITHS,
Gareth-John (GB/CH); Bäretstrasse 2a, CH-3930
Visp (CH). LANGE, Silvia (DE/CH); Bielastrasse 79,

CH-3900 Brig (CH). BRIEDEN, Walter (DE/CH);
Bleika, CH-3938 Ausserberg (CH).

(74) Gemeinsamer Vertreter: LONZA AG; Münchensteiner-
strasse 38, CH-4052 Basel (CH).

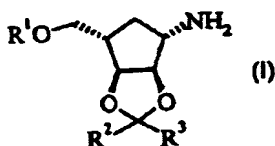
(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES,
FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,
MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG,
PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM,
TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM,
ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW,
GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG,
ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU,
TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK,
EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL,
PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI,
CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(Fortsetzung auf der nächsten Seite)

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF 3-AMINO-5-(HYDROXYMETHYL)CYCLOPENTANE-1,2-DIOL
DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON 3-AMINO-5-(HYDROXYMETHYL)CYCLOPENTAN-1,2-DI-
OLDERIVATEN



(57) Abstract: The invention relates to a method for the production of acetals and ketals of 3-amino-5-(hydroxymethyl)cyclopentane-1,2-diols of formula (I) (and/or the enantiomer), where R¹ = H, C₁₋₆ alkyl, C₃₋₈ cycloalkyl or benzyl and i) R² = methyl and R³ = ethyl, ii) R² = H and R³ = C₁₋₆ alkyl or phenyl or iii) R² and R³ together form a group of formula -(CH₂)_n- with n = 4 to 6, present as free amines or as salts of di- or tri-basic organic acids, starting from 2-acetyl-2-aza-bicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-one of formula (II) (and/or the enantiomer). The method is equally useful, depending on the starting material, for the production of enantiomerically-pure compounds, or mixtures with arbitrary enantiomeric content.

(57) Zusammenfassung: Gegenstand der Erfindung ist ein Verfahren zur Herstellung von Acetalen und Ketalen von 3-Amino-5-(hydroxymethyl)cyclopentan-1,2-diolen der Formel (I) und/oder Spiegelbild worin R¹ Wasserstoff, C₁₋₆-Alkyl, C₃₋₈-Cycloalkyl oder Benzyl ist und worin i) R² Methyl und R³ Ethyl, ii) R² Wasserstoff und R³ C₁₋₆-Alkyl oder Phenyl oder iii) R² und R³ zusammen eine Gruppe der Formel -(CH₂)_n- mit n = 4 bis 6 bedeuten, und die als freie Amine oder als Salze zwei- oder dreibasiger organischer Säuren vorliegen, ausgehend von 2-Acetyl-2-azabicyclo[2.2.1]hept-5-en-3-on der Formel (II) und/oder Spiegelbild Das Verfahren ist, abhängig von der Zusammensetzung des Eduktes, gleichermassen geeignet zur Herstellung enantiomerenreiner Verbindungen oder von Gemischen beliebiger Enantiomerenzusammensetzung.